

DOCKET NO.: 199505US0PCT

09/581549

534 Rec'd PCT/PTC 13 JUL 2000
IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

#3
PY
9.19.00

IN RE APPLICATION OF: Toshio MURAKAMI, et al.

SERIAL NO.: NEW U.S. PCT APPLICATION

FILED: HERewith

INTERNATIONAL APPLICATION NO.: PCT/JP99/00083

INTERNATIONAL FILING DATE: 13 JANUARY 1999

FOR: DISINTEGRANT

REQUEST FOR PRIORITY UNDER 35 U.S.C. 119
AND THE INTERNATIONAL CONVENTION

Assistant Commissioner for Patents
Washington, D.C. 20231

Sir:

In the matter of the above-identified application for patent, notice is hereby given that the applicant claims as priority:

<u>COUNTRY</u>	<u>APPLICATION NO</u>	<u>DAY/MONTH/YEAR</u>
JAPAN	10/5610	14 JANUARY 1998

Certified copies of the corresponding Convention application(s) were submitted to the International Bureau in PCT Application No. **PCT/JP99/00083**. Receipt of the certified copy(s) by the International Bureau in a timely manner under PCT Rule 17.1(a) has been acknowledged as evidenced by the attached PCT/IB/304.

Respectfully submitted,
OBLON, SPIVAK, McCLELLAND,
MAIER & NEUSTADT, P.C.



Norman F. Oblon
Attorney of Record
Registration No. 24,618
Surinder Sachar
Registration No. 34,423



22850

(703) 413-3000
Fax No. (703) 413-2220
(OSMMN 1/97)



13.01.99

5

09/581549

日 本 国 特 許 庁

PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日
Date of Application:

1998年 1月14日

REC'D 05 MAR 1999

WIPO PCT

出 願 番 号
Application Number:

平成10年特許願第005610号

出 願 人
Applicant (s):

第一製薬株式会社

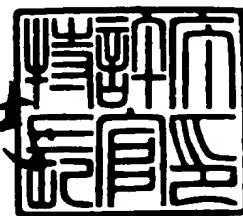
PRIORITY
DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

1999年 2月19日

特 許 庁 長 官
Commissioner,
Patent Office

山 佐 平 建 志



出証番号 出証特平11-3007007

【書類名】 特許願

【整理番号】 I98011401A

【提出日】 平成10年 1月14日

【あて先】 特許庁長官 荒井 寿光 殿

【国際特許分類】 A61K 47/00

【発明の名称】 崩壊剤

【請求項の数】 5

【発明者】

【住所又は居所】 東京都江戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内

【氏名】 村上 敏男

【発明者】

【住所又は居所】 東京都江戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内

【氏名】 井 紀孝

【発明者】

【住所又は居所】 東京都江戸川区北葛西1丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内

【氏名】 櫻井 裕之

【特許出願人】

【識別番号】 000002831

【氏名又は名称】 第一製薬株式会社

【代表者】 鈴木 正

【電話番号】 03-3680-0151

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 005131

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【書類名】 明細書

【発明の名称】 崩壊剤

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 室温で固体であり、37℃における水に対する溶解度が30重量%以上で、かつ、37℃における飽和水溶液の粘度が50 mPa・s 以下である物質を含有する崩壊剤。

【請求項 2】 エリスリトール、トレハロース及びキシリトールからなる群より選ばれる1種又は2種以上の物質を含有する崩壊剤。

【請求項 3】 請求項 1 または 2 記載の崩壊剤を含有する固形製剤。

【請求項 4】 室温で固体であり、37℃における水に対する溶解度が30重量%以上で、かつ、37℃における飽和水溶液の粘度が50 mPa・s 以下である物質を含有する崩壊剤の含有量が、固形製剤の全重量に対して、5～99重量%である固形製剤。

【請求項 5】 エリスリトール、トレハロース及びキシリトールからなる群より選ばれる1種又は2種以上の物質を含有する崩壊剤の含有量が、固形製剤の全重量に対して、5～99重量%である固形製剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、医薬品や健康食品などの分野で用いられる固形製剤の崩壊剤に関する。

【0002】

【従来技術】

経口投与される医薬品や健康食品などは、投与後、消化器官に到達して、医薬品や健康食品に含まれる薬効成分や栄養成分が吸収され、生体内に分布して効果が発揮されるものである。経口投与の剤形としては、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、細粒剤、丸剤、散剤等が挙げられる。これらは、さらに体内での薬効成分や栄養成分の吸収性を向上させるための手段や服用性の向上を狙いとした工夫を行うことが多い。

特平 10-005610

【物件名】	図面	1
【物件名】	要約書	1
【プルーフの要否】	要	

【0003】

製剤の崩壊性が良くないと消化管内での溶出が十分でなく、それに伴い吸収性が低下する場合がある。そこで、崩壊性を向上させる方法として、製剤に水膨潤性の崩壊剤を配合することが行われている。水膨潤性の崩壊剤としては、例えば、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、カルメロース、カルメロースカルシウムなどが良く用いられている。

【0004】

これら水膨潤性の崩壊剤は、水には不溶であるが、吸湿や水との接触によって体積膨張を生じるという特性を有する。このため、錠剤などの固形製剤に配合する場合には、吸湿による製剤の体積膨張や吸湿による錠剤の硬度低下などを考慮して製剤設計する必要がある。特に、フィルムコーティング錠や糖衣錠では素錠中に水膨潤性の崩壊剤を多く配合すると、経時的な吸湿によって、フィルムコーティング層のヒビ割れや糖衣層のヒビ割れ、破裂などが生じる問題がある。また、セルロース類などは、粒子径が比較的大きい繊維状の物質であるため、服用時に口腔内でザラツキ感を生じ易く、服用感が悪くなるという欠点がある。特に、口腔内で速やかに崩壊又は溶解する成形物や顆粒剤、散剤ではこの影響が大きい。

【0005】

固形製剤の崩壊性を改善する工夫として、上述の水膨潤性の崩壊剤の配合が一般的であるが、水に対する親和性（ぬれ性の改善）を高めるために、界面活性剤などを添加する方法も知られている。しかしながら、界面活性剤は安全性に問題があり、好ましい添加物ではない。

【0006】

【発明が解決しようとする課題】

本発明は、吸湿等により、製剤の安定性が経時的に悪くなる水膨潤性の崩壊剤に代わる、前記欠点が改善された新たな崩壊剤を提供することを目的とする。

【0007】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは、鋭意検討した結果、室温で固体で、37℃における水に対する

溶解度が30重量%以上で、かつ、37℃における飽和水溶液の粘度が50 mPa・s以下である物質が新たな崩壊剤として利用できることを見出し、本発明を完成した。

【0008】

【発明の実施の形態】

本発明は、室温で固体であり、37℃における水に対する溶解度が30重量%以上で、かつ、37℃における飽和水溶液の粘度が50ミリパスカル・秒（mPa・s）以下である物質を含有する崩壊剤、およびこの崩壊剤を含有する固形製剤に関する。

【0009】

以下、本発明について詳しく説明する。なお、室温で固体であり、37℃における水に対する溶解度が30重量%以上で、かつ、37℃における飽和水溶液の粘度が50 mPa・s以下である物質を含有する崩壊剤を、本発明の崩壊剤という。本発明において、室温とは1～30℃を意味するが、本発明の崩壊剤としては、30℃で固体であるものが好ましい。

【0010】

本発明の崩壊剤を固形製剤に配合すると、本発明の崩壊剤の水に対する溶解度が大きく、また、水への溶解速度が速く、かつ、飽和水溶液の粘度が低いため、固形製剤中への水の浸透性が良くなり、崩壊剤の溶解に伴って、固形製剤は崩壊又は溶解するものと考えられる。また、吸湿や水との接触により体積膨張を伴わないため、経時的に安定である。

【0011】

本発明の崩壊剤としては、例えば、エリスリトール、トレハロース、キシリトール、マルトース、酢酸カリウム、酢酸ナトリウム、クエン酸ナトリウムおよびリン酸二カリウム等を挙げることができ、このうち特に、エリスリトール、トレハロースおよびキシリトールが好ましい。これらの崩壊剤は、いずれか1種を用いてもよいし、2種以上を組み合わせ用いてもよい。

【0012】

エリスリトールは、ブドウ糖発酵甘味料で、4価の糖アルコールであり、融点

119℃の白色の結晶性粉末で、水に溶け易く、溶解熱 -42.9 cal/g で冷感を有し、吸湿性がなく、砂糖の70～80%の甘味度を有する甘味剤である。トレハロース(α , α -トレハロース)は、融点97℃の白色結晶性粉末で、水に溶け易く、吸湿性がなく(2含水結晶)、砂糖の約45%の甘味度を有する甘味剤である。キシリトールは、5価の糖アルコールであり、融点93～95℃の白色結晶性粉末で、水に極めて溶け易く、溶解熱 -35 cal/g で冷感を有し、吸湿性はややあり、砂糖と同程度の甘味度を有する甘味剤である。

【0013】

本発明の崩壊剤の配合量は、固形製剤の全重量に対して、5～99重量%の範囲が適当であるが、より好ましくは10～99重量%、さらに好ましくは20～99重量%である。5重量%未満では、崩壊又は溶解改善作用が低下し、固形製剤の崩壊性又は溶解性が劣る。

【0014】

エリスリトール、トレハロースおよびキシリトールなどは、賦形剤としても使用できることから、これらは多量に配合しても何ら支障はなく、むしろ多い程、崩壊又は溶解改善作用が向上する。ただし、エリスリトールを錠剤に配合する場合は、エリスリトールを多く配合すると成形性が悪くなり、錠剤の硬度が高くないという問題が生じるため、好ましくは80重量%以下が適当である。

【0015】

本発明の崩壊剤は、固形製剤の崩壊性又は溶解性を改善する効果があり、特にフィルムコーティング錠や糖衣錠の素錠の崩壊性を改善するのに適している。例えば、エリスリトールは吸湿性がなく、膨潤性もないため、素錠に多く配合しても経時的な吸湿によるフィルムコーティング錠のヒビ割れや糖衣錠のヒビ割れ、破裂などが生じない。また、従来から使用されている低置換度ヒドロキシプロピルセルロース等の水膨潤性の崩壊剤とエリスリトールとを併用することによって、従来の水膨潤性の崩壊剤の配合量を減じることができるので、固形製剤の全重量を減じることができる。したがって、製剤の小型化が可能である。

【0016】

また、本発明の崩壊剤は、口腔内で速やかに崩壊又は溶解する成形物、チュア

ブル錠、顆粒剤、散剤等に配合するのが効果的である。すなわち、従来から使用されている低置換度ヒドロキシプロピルセルロース等のセルロース類などと異な
って、本発明の崩壊剤は繊維状の物質ではないため、口腔内でのザラツキ感がな
く、また速やかに溶解するため、服用性の優れた固形製剤とすることができる。

【0017】

本発明において、固形製剤の剤形は特に限定されるものではない。剤形として
は、例えば、錠剤、トローチ剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤および丸剤等を挙げ
ることができる。錠剤には、チュアブル錠、発泡錠や口腔内で速やかに溶解、崩
壊し、水なしでも服用できる成形物等を挙げることができる。また、顆粒剤、散
剤には用時溶解して用いるドライシロップ剤を含み、また口腔内で速やかに溶解
、崩壊し、水なしでも服用できる粒状物をも含む。

【0018】

本発明の崩壊剤は、医薬品や健康食品などに配合することができる。これら医
薬品や健康食品に含まれる薬効成分や栄養成分などには、特に制限はなく、用途
に応じて配合することができる。これらの成分は、粉末状、結晶状、油状、溶液
状など何れの形状のものでも良い。

【0019】

医薬品や健康食品に含まれる成分としては、例えば、ビタミンA、ビタミンB
₁（塩酸チアミンなど）、ビタミンB₂、ビタミンB₆、ビタミンB₁₂、ビ
タミンC（アスコルビン酸、アスコルビン酸ナトリウムなど）、ビタミンD、ビ
タミンE、ニコチン酸アミド、パントテン酸カルシウム、パンテチン、イブシロン
アミノカプロン酸、トラネキサム酸、ガンマアミノ酪酸、塩化カルプロニウム、
塩酸プロカインアミド、酒石酸アリメマジン、イソニアジド、塩酸ピルジカイニ
ド、塩酸チクロピジン、マレイン酸シネパジド、スルピリン、アスピリン、アセ
トアミノフェン、エテンザミド、イブプロフェン、ケトプロフェン、インドメタ
シン、シメチジン、ファモチジン、カフェイン、オフロキサシン、レボフロキサ
シン、ナリジクス酸、カルベジロール、スルファジメトキシシン、レセルピン、塩
酸ロフェブラミン、マロチラート、バクロフェン、プロブコール、スルファモノ
メトキシシン、レボドパ、チミペロン、塩酸セトラキサート、フロプロピオン、ブ

トララジン、オキシペルチン、エピリゾール等を挙げることができる。薬効成分や栄養成分は、固形製剤に1種又は2種以上が配合されていてもよい。

【0020】

本発明の崩壊剤を含む固形製剤には、本発明の崩壊剤の効果（崩壊時間の短縮、経時安定性の向上など）に支障のないかぎり、一般に用いられる種々の製剤添加物の適当量をさらに含んでも良い。製剤添加物としては、例えば、賦形剤、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、着色剤、甘味剤、矯味剤等を挙げることができる。以下に、これらの具体例を挙げる。

【0021】

賦形剤としては、乳糖、白糖、果糖、ブドウ糖、マンニトール、ソルビトール、キシリトール、エリスリトール、トレハロース、マクロゴール、粉末還元麦芽糖水アメ、還元乳糖などの水溶性賦形剤、トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、乾燥水酸化アルミニウムゲル、ケイ酸アルミン酸マグネシウム、ケイ酸カルシウム、合成ケイ酸アルミニウム、合成ヒドロタルサイト、含水二酸化ケイ素、酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、炭酸カルシウム、リン酸水素カルシウムなどの水不溶性賦形剤を挙げることができる。

【0022】

崩壊剤としては、部分アルファ化デンプン、ヒドロキシプロピルスターチ、カルボキシメチルスターチナトリウムなどのデンプン類、結晶セルロース、粉末セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、カルメロースカルシウム、クロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルエチルセルロースなどのセルロース類、アルギン酸、グアガム、カゼインホルムアミド、ペクチン、イオン交換樹脂、架橋ポリビニルピロリドンなどの高分子化合物、ベントナイト（コロイド性含水ケイ酸アルミニウム）、ビーガム（ケイ酸マグネシウムとケイ酸アルミニウムの混合物）などの無機物質類等を挙げることができる。

【0023】

結合剤としては、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン

等を挙げることができる。

【0024】

滑沢剤としては、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、タルク、シヨ糖脂肪酸エステル等を挙げることができる。

【0025】

着色剤としては、食用黄色5号色素、食用赤色2号色素、食用青色2号色素、食用レーキ色素、黄色三二酸化鉄、酸化チタン等を挙げることができる。

【0026】

甘味剤としては、アスパルテーム、ステビア、ソーマチン、サッカリンナトリウム、グリチルリチン酸二カリウム等を挙げることができる。

【0027】

矯味剤としては、L-メントール、カンフル、ハッカ、L-グルタミン酸ナトリウム、イノシン酸二ナトリウム、塩化マグネシウム等を挙げることができる。

【0028】

これらの製剤添加物は、固形製剤の製造に際して、適宜適当な工程で添加すればよい。

【0029】

本発明の崩壊剤を含む固形製剤は、公知の固形製剤の製造方法により製することができる。例えば、造粒方法としては、流動層造粒法、攪拌造粒法、転動流動層造粒法、押し出し造粒法、噴霧造粒法及び破碎造粒法等を用いることができる。

【0030】

以下に、流動層造粒法を用いた製造方法の一例を説明する。

【0031】

薬効成分および／または栄養成分に、エリスリトール、所望により乳糖、トウモロコシデンプン等の賦形剤を加え、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール等の結合剤の水溶液を用いて流動層造粒乾燥機で造粒し、所望によりアスパルテーム等の甘味剤を加えて、混合機で混合し、顆粒剤、散剤または細粒剤とすればよい。また、得られた造粒物にステアリン酸マグネシウム、タルク

等の滑沢剤を必要量添加して、混合した後、常法により打錠機で打錠し、錠剤やチュアブル錠とすることもできる。

【0032】

【発明の効果】

本発明の崩壊剤を含む固形製剤は、従来から用いられている水膨潤性の崩壊剤と同等以上の崩壊時間の短縮効果を示す。また、本発明の崩壊剤は膨潤性を有しないため、経時的な吸湿による体積膨張が生じないことから、とりわけ、フィルムコーティング錠や糖衣錠の経時安定性が向上する。さらには、口腔内で速やかに崩壊又は溶解する成形物やチュアブル錠、顆粒剤、散剤に適用した場合、口腔内でザラツキ感がなく、速やかに溶解するため、服用性の優れた固形製剤とすることができる。また、本発明の崩壊剤を含む固形製剤は、工程数が多い等の複雑な製造法を必要とせず、一般的な製造法で製造することができ、経済的で工業生産性の高いものである。

【0033】

【実施例】

以下に、実施例を挙げて本発明を更に詳細に説明するが、本発明はこれらの実施例のみに限定されるものではない。

【0034】

試験方法

本発明を詳細に説明するため、下記の試験を実施した。

(1) 水に対する溶解度の測定

37℃における、各試料の飽和水溶液を調製した後、メンブランフィルターでろ過し、ろ液の一定量の重量を正確に秤り、凍結乾燥法により乾燥し、水分量を求め算出した。

(2) 飽和水溶液の粘度測定

37℃における、各試料の飽和水溶液を調製した後、メンブランフィルターでろ過し、ろ液を用いて、B型粘度計で37℃における粘度を測定した。

(3) 錠剤硬度

錠剤硬度計〔フロイント産業（株）：シュロイニゲル錠剤硬度計〕を用いて、

直径方向の硬度を測定した。試験は5錠について行い、その平均値を示す。

(4) 崩壊試験

日本薬局方第13改正の錠剤の項に記載されている崩壊試験法に従い、補助盤を用いずに測定した〔富山産業(株)：崩壊試験器〕。試験は6錠について行い、その平均値を示す。

【0035】

〔試験例1〕

試験例として、エリスリトール、トレハロース、キシリトール、マルトース、酢酸カリウム、酢酸ナトリウム、クエン酸ナトリウムを用いて、37℃における飽和溶解度及び飽和水溶液の粘度を測定した。また、参考例として、乳糖、D-マンニトール、D-ソルビトール、還元麦芽糖水アメ、還元乳糖、ブドウ糖、白糖について、実施例と同様に飽和溶解度及び飽和水溶液の粘度を測定した。結果を表1に示す。

操作し、打錠し、比較例とした。得られた錠剤について、崩壊試験を行った。結果を表3及び図1に示す。

【0038】

【表2】

表2

処方	実施例 1-1	実施例 1-2	実施例 1-3	比較例 1
乳糖	247	219	191	275
トウモロコシデンプン	106	94	82	118
エリスリトール	40	80	120	—
ヒドロキシプロピルセルロース	5	5	5	5
ステアリン酸マグネシウム	2	2	2	2
合計	400	400	400	400

注) 処方中の数値の単位は g である。

【0036】

【表1】

表1

	試料	溶解度 (37℃) w/w%	粘度 (37℃) mP・s
試験例	エリスリトール	45	3.5
	トレハロース	50	11
	キシリトール	74	37
	マルトース	46	38
	酢酸カリウム	76	30
	酢酸ナトリウム	38	5.2
	クエン酸ナトリウム	36	5.8
参考例	乳糖	25	1.7
	D-マンニトール	24	1.6
	D-ソルビトール	88以上*1	2090以上
	還元麦芽糖水アメ	79	488
	還元乳糖	74	218
	ブドウ糖	83	282
	白糖	78	1120

注) *1 溶解度が大きく、飽和溶液の調製が困難であった。

【0037】

【実施例1】

—流動層造粒乾燥機に、乳糖及びトウモロコシデンプンを表2に記載の実施例1-1～1-3の処方で添加し、3分間混合した後、ヒドロキシプロピルセルロースの5w/v%水溶液100mlを用いてスプレー圧1.5kg/cm²、スプレー液速度15ml/分で造粒を行った。乾燥後、16メッシュ篩(1000μm)で篩過した。これに、エリスリトール〔日研化学(株)製：42メッシュ(350μm)通過品〕及びステアリン酸マグネシウムを、表2に記載の実施例1-1～1-3の処方で添加し、混合した。次に、単発打錠機を用いて、10mmφ隅角平面の杵で、錠剤重量400mg、打錠圧力として低圧、中圧、高圧の3水準で打錠した。また、表2に記載の比較例1の処方により、実施例1と同様に

【0039】

【表 3】

表 3

	打錠圧	重量 (g)	硬度 (kg)	崩壊時間 (分)
実施例 1-1	低圧	402	2.0	3.2
	中圧	400	4.9	2.8
	高圧	400	8.0	3.3
実施例 1-2	低圧	400	1.3	1.8
	中圧	403	4.2	1.5
	高圧	404	6.6	2.0
実施例 1-3	低圧	402	1.0	1.2
	中圧	401	2.9	1.3
	高圧	399	5.0	1.3
比較例 1	低圧	402	2.6	3.3
	中圧	404	6.8	3.4
	高圧	400	10.4	3.4

【0040】

表 3 及び図 1 から明らかなように、実施例 1-1～1-3 は、比較例 1 に比べ、崩壊時間が短縮した。また、エリスリトールの配合量が多くなるに従って、崩壊時間の短縮効果が認められた。

【0041】

【実施例 2】

流動層造粒乾燥機に、エテンザミド及びトウモロコシデンプンを表 4 に記載の実施例 2 の処方で添加し、3 分間混合した後、ヒドロキシプロピルセルロースの 5 w/v % 水溶液 200 ml を用いて、スプレー圧 1.5 kg/cm²、スプレー液速度 15 ml/分 で造粒を行った。乾燥後、16 メッシュ篩で篩過した。これに、エリスリトール及びステアリン酸マグネシウムを表 4 に記載の実施例 2 の

処方で添加し、混合した。次に、単発打錠機を用いて、10mmφ隅角平面の杵で、錠剤重量400mg、打錠圧力として低圧、中圧、高圧の3水準で打錠した。また、表4に記載の比較例2-1及び2-2の処方により、実施例2と同様に操作し、打錠し、比較例とした。得られた錠剤について、崩壊試験を行った。結果を表5及び図2に示す。

【0042】

【表4】

表4

処方	実施例2	比較例2-1	比較例2-2
エテンザミド	250	250	250
トウモロコシデンプン	56	136	56
エリスリトール	80	—	—
低置換度ヒドロキシプロピルセルロース	—	—	80
ヒドロキシプロピルセルロースL	10	10	10
ステアリン酸マグネシウム	4	4	4
合計	400	400	400

注) 処方中の数値の単位はgである。

【0043】

【表 5】

表 5

	打錠圧	重量 (g)	硬度 (kg)	崩壊時間 (分)
実施例 2	低圧	404	4.1	1.7
	中圧	405	8.1	2.5
	高圧	406	11.8	3.3
比較例 2-1	低圧	401	3.5	14.6
	中圧	400	8.2	18.7
	高圧	403	12.3	13.7
比較例 2-2	低圧	409	3.0	2.4
	中圧	404	7.9	4.2
	高圧	404	11.2	7.0

【0044】

表 5 及び図 2 から明らかなように、実施例 2 は、比較例 2-1 に比べ、崩壊時間の短縮効果が認められた。また、水膨潤性の賦形剤である低置換度ヒドロキシプロピルセルロースを配合した比較例 2-2 と比較して、同等以上の崩壊時間の短縮効果が認められた。

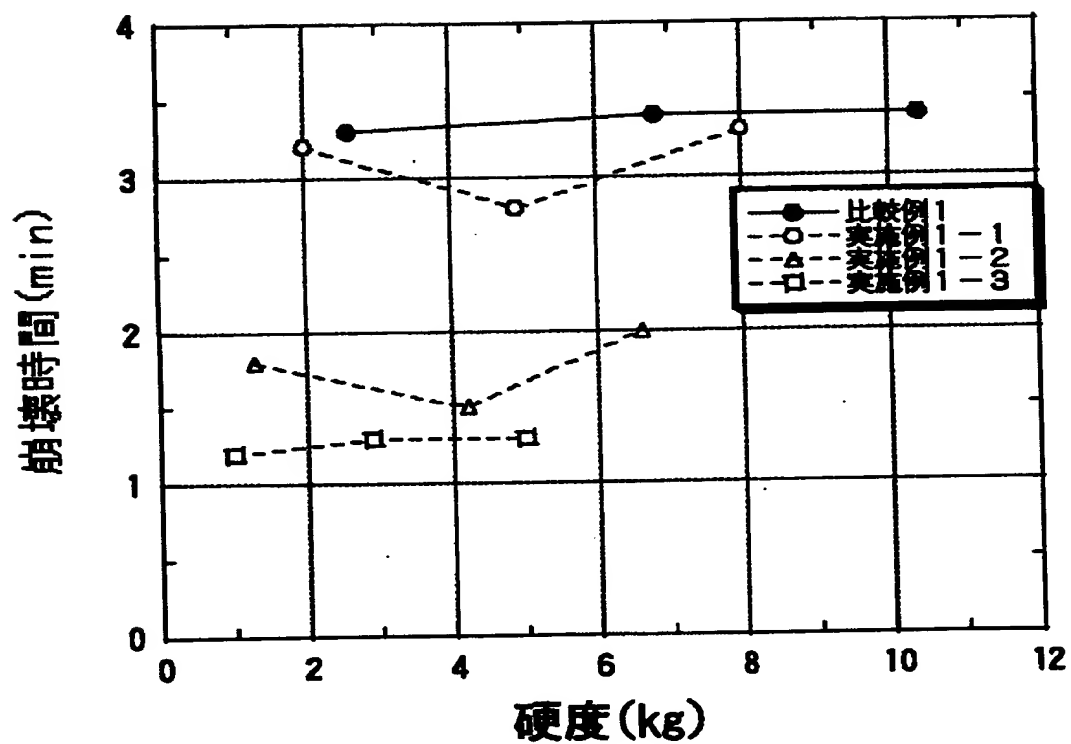
【図面の簡単な説明】

【図 1】 実施例 1-1 ～ 1-3 および比較例 1 における、崩壊時間と硬度の関係を示す図である。

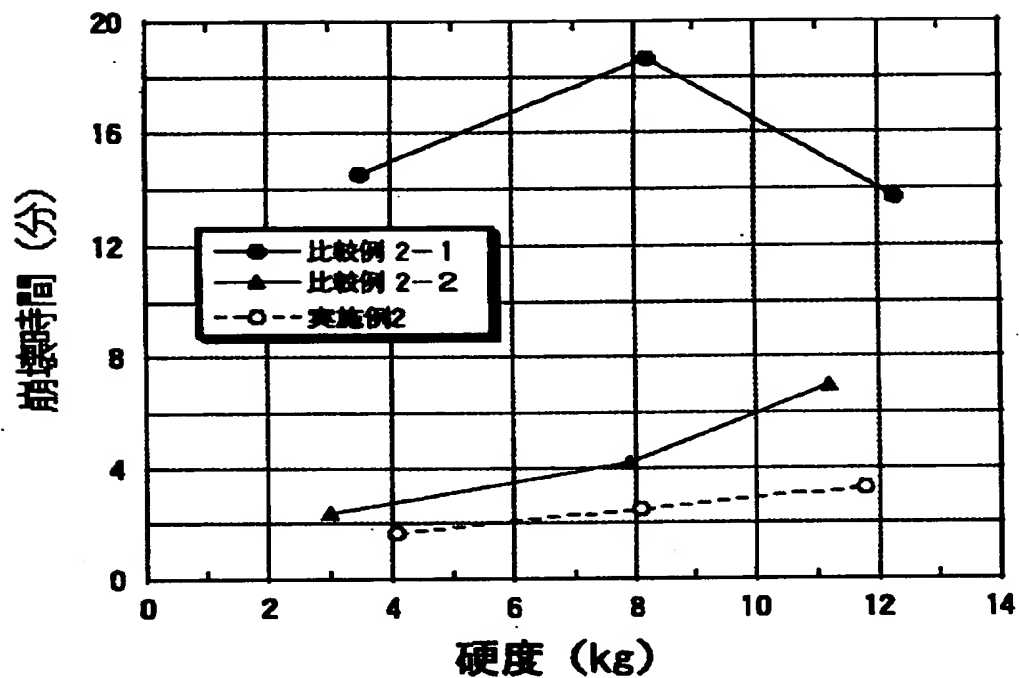
【図 2】 実施例 2 および比較例 2-1、2-2 における、崩壊時間と硬度の関係を示す図である。

【書類名】 図面

【図1】



【図2】



【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 吸湿等により、経時的に製剤の安定性が悪くなる、低置換度ヒドロキシプロピルセルロースなどの水膨潤性の崩壊剤に代わる、新たな崩壊剤を提供する。

【解決手段】 室温で固体であり、37℃における水に対する溶解度が30重量%以上で、かつ、37℃における飽和水溶液の粘度が50 mPa・s 以下である物質を含有する崩壊剤。

【選択図】 なし。

【書類名】
【訂正書類】

職権訂正データ
特許願

<認定情報・付加情報>

【特許出願人】

申請人

【識別番号】

000002831

【住所又は居所】

東京都中央区日本橋3丁目14番10号

【氏名又は名称】

第一製薬株式会社

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号 [000002831]

1. 変更年月日	1990年 8月28日
[変更理由]	新規登録
住 所	東京都中央区日本橋3丁目14番10号
氏 名	第一製薬株式会社